

アジド基保護を利用したアミノアルコール類の合成

(東理大院先進工) ○浪岡 璃奈¹・鈴木 美之里²・吉田 優

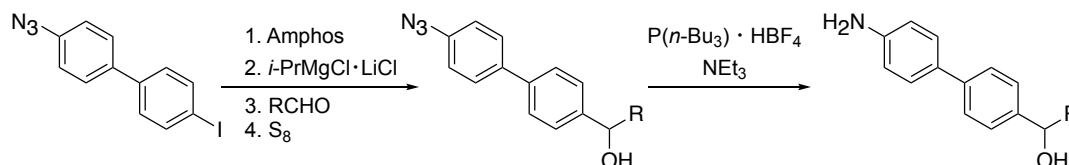
Synthesis of Amino Alcohols through the Protection of Azides (Tokyo University of Science)

○Rina Namioka, Minoru Suzuki, Suguru Yoshida

Azides are important intermediates in the synthesis of amines. However, it is not easy to synthesize azides due to the labile azido groups under harsh conditions. Herein, we succeeded in the synthesis of alcohols having an azido group via the iodine-magnesium exchange reaction of iodine-substituted phosphazides prepared from azides followed by treatment with electrophiles. Furthermore, we succeeded in synthesizing amino alcohols by reducing azides having a hydroxy group.

Keywords: Azide; Phosphazide; Protection; Halogen-metal exchange; Amino alcohol

アジドはアミン合成における重要な中間体である。しかし、アジド基が過酷な条件下で損なわれやすいため、多彩なアジド化合物の合成は必ずしも容易ではない¹。これに対して、我々は、安定なホスファジド形成による保護法^{2,3}を利用した場合にも、ヨウ素-マグネシウム交換反応が効率的に進行することを見だし、生じる有機マグネシウム中間体がアジド基を含有するカルバニオンの等価体として有用であることを明らかにした⁴。今回我々は、Amphos (*t*-Bu₂PC₆H₄-4-NMe₂) をアジドに作用させてホスファジドを形成した後、ヨウ素-マグネシウム交換反応によってカルバニオンを発生でき、種々のアルデヒドとの反応で幅広いアジドアルコール類を合成できた。さらに、引き続くアジド基の還元によってアミノアルコール類の合成に成功した。



1) D. Ichinari, Y. Ashikari, K. Mandai, Y. Aizawa, J. Yoshida, A. Nagaki, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2020**, 59, 1567.

2) T. Meguro, S. Yoshida, K. Igawa, K. Tomooka, T. Hosoya, *Org. Lett.* **2018**, 47, 1216.

3) T. Aimi, T. Meguro, A. Kobayashi, T. Hosoya, S. Yoshida, *Chem. Commun.* **2021**, 57, 6062.

4) 浪岡璃奈, 鈴木美之里, 吉田優, 日本化学会第 102 春季年会(2022), K5-4am-03.